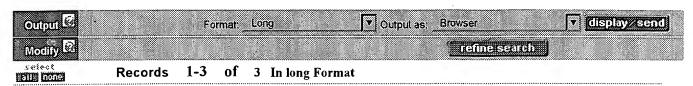


🕸 Dynamic Search: INPADOC/Family and Legal Status, JAPIO - Patent Abstracts of Japan, Derwent World Patents Index

■ Records for: pn=jp 7138135

ceve at elect. | ceet ctrices/enly-



10/34/1 (Item 1 from file: 351)

010326957

WPI Acc No: 1995-228598/199530

5-Alpha-reductase inhibitors used as lotions to promote hair growth - contain plant extracts of Smilax zeylanica, phyllanthus nuriri, Woodfordia fruiticosa, Lagerstroemia speciosa and/or Cymbopogon nardus.

Patent Assignee: MIKIMOTO SEIYAKU KK (MIKI-N); NANBA T (NANB-I)

Number of Countries: 001 Number of Patents: 001

Patent Family:

Patent No Kind Date Applicat No Kind Date Week JP 7138135 A 19950530 JP 93288451 A 19931117 199530 B

Priority Applications (No Type Date): JP 93288451 A 19931117

Patent Details:

Patent No Kind Lan Pg Main IPC Filing Notes

JP 7138135 A 5 A61K-007/06

Abstract (Basic): JP 7138135 A

5-alpha-reductase inhibitors contg one or more plant extracts of Smilax zeylanica, phyllanthus nuriri, Woodfordia fruticosa, Lagerstroemia speciosa, or Cymbopogon nardus, are new.

The plant is extracted in organic solvent such as ethanol, or methanol.

 $\ensuremath{\mathsf{USE}}$ - 5 alpha reductase inhibitors are used as hair-growing agents such as hair lotion.

In an example, dried root of Smilax zeylanica (10g) was extracted in 50% ethanol (300 ml) for 5 days, and freeze-dried to give the Smilax extract. The extract (0.5 wt%), olive oil (0.5%), polyoxyethylene sorbitan monostearate (2.0%), polyoxyethylene hardened castor oil (2.0%, ethanol (30.0%), 1.0% sodium hyaluronate-contg aq soln (5.0%) and refined water (60.0%) were formed into a hair lotion.

Dwg.0/0

Derwent Class: B04; D21

International Patent Class (Main): A61K-007/06

International Patent Class (Additional): A61K-035/78

Derwent WPI (Dialog® File 351): (c) 2001 Derwent Info Ltd. All rights reserved.

10/34/2 (Item 2 from file: 347) 04845535 5ALPHA-REDUCTASE INHIBITOR

Pub. No.: 07-138135 [JP 7138135 A] **Published:** May 30, 1995 (19950530)

Inventor: NANBA TSUNEO
HATTORI YUKIO
SHIMOMURA KENJI
YAMABE YUKIHISA
IIDA KOICHI

Applicant: MIKIMOTO PHARMACEUT CO LTD [470806] (A Japanese Company or

Corporation), JP (Japan)

NANBA TSUNEO [000000] (An Individual), JP (Japan)

Application No.: 05-288451 [JP 93288451] **Filed:** November 17, 1993 (19931117)

International Class: [6] A61K-007/06; A61K-007/00; A61K-035/78; A61K-035/78

JAPIO Class: 14.4 (ORGANIC CHEMISTRY -- Medicine)
JAPIO Keyword: R059 (MACHINERY -- Freeze Drying)

ABSTRACT

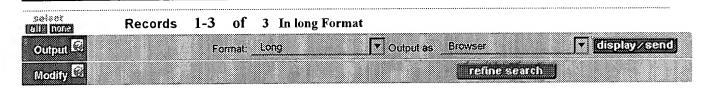
PURPOSE: To provide a 5 alpha -reductase inhibitor safely applicable to the skin, having high 5 alpha -reductase inhibiting action and effective for hair-growing.

CONSTITUTION: This 5 alpha reductase inhibitor contains a solvent extract of at least one kind of plant selected from Sumilax zeylanica, Phyllanthus nuriri, Woodfordia fruticosa, Lagerstroemia speciosa and Cymbopogon nardus. The extraction solvent is water or a hydrophilic organic solvent (e.g. ethanol, methanol or acetone) and especially preferably water, ethanol or their mixture. A hair-growing agent compounded with the inhibitor exhibits remarkable hair- growing effect.

JAPIO (Dialog® File 347): (c) 2001 JPO & JAPIO. All rights reserved.

3. (Item 3 from file: 345) 10/34/3 12417656 Basic Patent (No, Kind, Date): JP 7138135 A2 950530 PATENT FAMILY: JAPAN (JP) Patent (No, Kind, Date): JP 7138135 A2 5ALPHA-REDUCTASE INHIBITOR (English) Patent Assignee: MIKIMOTO SEIYAKU KK; NANBA TSUNEO Author (Inventor): NANBA TSUNEO; HATTORI YUKIO; SHIMOMURA KENJI; YAMABE YUKIHISA; IIDA KOICHI 931117 Priority (No, Kind, Date): JP 93288451 A Applic (No, Kind, Date): JP 93288451 A 931117 IPC: * A61K-007/06; A61K-007/00; A61K-035/78 123(10)122732U; 123(10)122732U CA Abstract No: * Derwent WPI Acc No: * C 95-228598; C 95-228598

Inpadoc/Fam.& Legal Stat (Dialog® File 345): (c) 2001 EPO. All rights reserved.



Language of Document: Japanese

©1997-2001 The Dialog Corporation -

PTO 2002-0274

S.T.I.C. Translations Branch

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11)特許出願公開番号

特開平7-138135

(43)公開日 平成7年(1995)5月30日

(51) Int.Cl.⁶

識別記号 庁内整理番号

FΙ

技術表示箇所

A 6 1 K 7/06

7/00

K

35/78

ADA W 8217-4C

AED

審査請求 未請求 請求項の数1 OL (全 5 頁)

(21)出願番号

特顏平5-288451

(71)出題人 000166959

御木本製薬株式会社

三重県伊勢市黒瀬町1425番地

(22)出願日 平成5年(1993)11月17日

(71)出願人 591168323

難波 恒雄

富山県富山市五福末広町2556-4 1-

104

(72)発明者 難波 恒雄

富山県富山市五福末広町2556-4 1-

104

(74)代理人 弁理士 藤本 博光 (外2名)

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 5 α-レダクターゼ阻害剤

(57)【要約】

【構成】 スミラックス ゼイラニカ、フィランサス ヌリリ、ウッドフォルディア フルーティコサ、オオバナサルスベリ、コウスイガヤよりなる群より選んだ少な くとも 1 種の植物体の溶媒抽出物を含む 5α - レダクターゼ阻害剤。

【効果】 本発明に使用した植物体の溶媒抽出物は5 α ーレダクターゼの活性を著しく阻害するので、これを配合した育毛料は顕著な効果を示す。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 スミラックス ゼイラニカ、フィランサス ヌリリ、ウッドフォルディア フルーティコサ、オオバナサルスベリ、コウスイガヤよりなる群より選んだ少なくとも1種の溶媒抽出物を含む5αーレダクターゼ 阻害剤。

【発明の詳細な説明】

[0001]

【産業上の利用分野】本発明は、育毛上障害となる5α ーレダクターゼの活性を阻害して、育毛に有効な5α- 10 レダクターゼ阻害剤に関する。

[0002]

【従来の技術】スミラックス ゼイラニカ (Smilax zey lanica) はユリ科シオデ属の植物で、インドやスリランカの1500m以上の高地によく見られる。その根はリュウマチ、赤痢、貧血、性病等に用いられる。

【0003】フィランサス ヌリリ (phyl lanthus nuri ri) はトウダイグサ科の植物で、熱帯地方に広く分布 し、スリランカでは荒れ地や耕地に雑草として分布する。

【0004】ウッドフォルディア フルーティコサ(Woodfordia fruticosa)はミソハギ科の植物でインド、スリランカの低山地の日当りのよい場所に分布している。 花は赤痢、葉は蛇に咬まれたときの薬として利用される。

【0005】オオバナサルスベリ(Lagerstroemia speciosa)は、ミソハギ科、サルスベリ属の植物で、インドに生える半落葉高木である。インドでは根は熱、下痢に、樹皮、葉は下剤として用いられる。

【0006】コウスイガヤ(Cymbopogon nardus)は単子葉植物網、イネ目、イネ科、オガルカヤ属の植物で、蚊の防虫剤、香料、石鹸の原料とされ、南アフリカでは駆虫剤、風邪の治療薬、解熱剤に使われている。

【0007】5α-レダクターゼは、育毛を妨げる還元 剤として作用する酵素として知られている。従って、この5α-レダクターゼの活性を阻害することは育毛に有 効に作用するものである。

【0008】一方、化粧料の原料として使用でき 5α ーレダクターゼ阻害作用のある物質としては種々の物質が知られているが、合成品は、長期間人間の肌に適応した 40場合の安全性の保証がなく、使用が制限されつつある。一方、天然物では 5α ーレダクターゼ阻害作用が弱いものが多い。しかし人の肌に対する安全性の面から天然物で、多年、人が食したりして、安全性の面で保証されており、しかも 5α ーレダクターゼ阻害作用が強いものが要求されていた。

[0009]

【発明が解決しようとする課題】本発明の目的は、皮膚 に適用して安全であると共に、5α-レダクターゼ阻害 作用が大きい5α-レダクターゼ阻害剤を提供すること 50 である。

[0010]

【課題を解決するための手段】本発明者らは、前記の課題を解決するため、すでに多年にわたって食用に供され、人体に対する安全性が確認されている植物をスクリーニングして調べ、 5α ーレダクターゼ阻害剤として利用価値のあるものを検討した。その結果、前記の植物体の溶媒抽出物が、 5α ーレダクターゼ阻害剤として、或いは医薬部外品として非常に有効であることを見い出し本発明を完成した。

【0011】すなわち本発明はスミラックス ゼイラニカ、フィランサス ヌリリ、ウッドフォルディア フルーティコサ、オオバナサルスベリ、コウスイガヤよりなる群より選んだ少なくとも1種の溶媒抽出物を含む5αーレダクターゼ阻害剤である。

【0012】これら植物体の利用方法としては、水或いは親水性有機溶媒例えば、エタノール、メタノール、アセトン等で抽出する。しかしながら人の皮膚に適用する 5 α ーレダクターゼ阻害剤原料の抽出であるから、水或 20 いはエタノール或いはこれの混合溶媒での抽出が好ましいのは当然である。

【0013】また、場合によっては、グリセリン、1、3ブチレングリコール、プロピレングリコール等の多価アルコール又は多価アルコールと水の混液も抽出に利用できる。またさらに凍結乾燥して粉体として利用することも利用方法によっては有効である。

【0014】この物質を他の化粧品原料例えばスクワラン、ホホバ油等の液状油、ミツロウ、セチルアルコール等の固体油、各種の活性剤、グリセリン、1,3ブチレングリコール等の保湿剤や各種薬剤等を添加してさまざまな剤形の5αーレダクターゼ阻害剤を調製することができる。例えばローション、クリーム、乳液、パック等で目的に応じて利用形態を考えればよい。

[0015]

トし凍結乾燥した。

【実施例】以下に本発明で使用する植物体の実際の利用 方法である抽出物の製造例、実施例を記載するが、本発 明はこれらの製造例、実施例によって何等限定されるも のではない。

【0016】(製造例1)スミラックス ゼイラニカの 根茎(乾燥品)10gに50%エタノール300m1を 加えて、時々撹拌しつつ5日間放置した。これを沪過後、エバポレートして、凍結乾燥した。

【0017】(製造例2)スミラックス ゼイラニカの 根茎(乾燥品)を10gに精製水300mlを加えて3時間加熱する。これを放冷した後沪過後凍結乾燥した。【0018】(製造例3)フィランサス ヌリリの全草(乾燥品)を10gにエタノール300mlを加えて時々撹拌しつつ5日間放置した。これを沪過後エバボレー

) 【0019】(製造例4)フィランサス ヌリリの全草

09/28/2001, EAST Version: 1.02.0008

(乾燥品)を10gに50%エタノール300m1を加 えて時々撹拌しつつ5日間放置した。これを沪過後エバ ボレートし凍結乾燥した。

【0020】(製造例5)フィランサス ヌリリの全草 (乾燥品)を10gに精製水300m1を加えて3時間 加熱する。これを放冷した後沪過後凍結乾燥した。

【0021】(製造例6) ウッドフォルディア フルー ティコサの花及び葉(乾燥品)を10gにエタノール3 00mlを加えて時々撹拌しつつ5日間放置した。これ を沪過後エバポレートし凍結乾燥した。

【0022】(製造例7) ウッドフォルディア フルー ティコサの花及び葉(乾燥品)を10gに50%エタノ ール300mlを加えて時々撹拌しつつ5日間放置し た。これを沪過後、エバポレートして、凍結乾燥した。 【0023】(製造例8) ウッドフォルディア フルー ティコサの花及び葉(乾燥品)を10gに精製水300 mlを加えて3時間加熱する。これを放冷した後沪過後 凍結乾燥した。

【0024】(製造例9)オオバナサルスベリの葉(乾 燥品)を10gにエタノール300mlを加えて時々撹 20 拌しつつ5日間放置した。これを沪過後エバポレートし 凍結乾燥した。

【0025】(製造例10)オオバナサルスベリの葉 (乾燥品)を10gに50%エタノール300mlを加 えて時々撹拌しつつ5日間放置した。これを沪過後エバ* (実施例1) ローションの調製

* ポレートし凍結乾燥した。

【0026】(製造例11)オオバナサルスベリの葉 (乾燥品)を10gに精製水300mlを加えて3時間 加熱する。これを放冷した後沪過後凍結乾燥した。

【0027】(製造例12) コウスイガヤの根茎(乾燥 品)を10gにエタノール300mlを加えて時々撹拌 しつつ5日間放置した。これを沪過後エバポレートし東 結乾燥した。

【0028】 (製造例13) コウスイガヤの根茎 (乾燥 10 品)を10gに50%エタノール300m1を加えて時 々撹拌しつつ5日間放置した。これを沪過後エバボレー トし凍結乾燥した。

【0029】(製造例14) コウスイガヤの根茎(乾燥 品)を10gに精製水300mlを加えて3時間加熱す る。これを放冷した後、沪過後凍結乾燥した。

【0030】(比較製造例1)カシュー(何首鳥)の塊 根(乾燥品)を10gに50%エタノール300mlを 加えて時々撹拌しつつ5日間放置した。これを沪過後エ バポレートし凍結乾燥した。

【0031】(比較製造例2)セージの種子(乾燥品) を10gに50%エタノール300m1を加えて時々撹 拌しつつ5日間放置した。これを沪過後エバポレートし 凍結乾燥した。

[0032]

(重量%) オリーブ油 0.5 製造例1の抽出物 0.5 ポリオキシエチレン(20E.O.) ソルビタンモノステアレート 2.0 ポリオキシエチレン (60E.O.) 硬化ヒマシ油 2.0 エタノール 30.0 1.0%ヒアルロン酸ナトリウム水溶液 5.0 精製水 60.0

【0033】(実施例2)実施例2は、実施例1の製造 例1の抽出物を製造例2の抽出物に変え作成したローシ ョン。

【0034】(実施例3)実施例3は、実施例1の製造 例1の抽出物を製造例3の抽出物に変え作成したローシ ョン。

【0035】(実施例4)実施例4は、実施例1の製造 例1の抽出物を製造例4の抽出物に変え作成したローシ ョン。

【0036】(実施例5)実施例5は、実施例1の製造 例1の抽出物を製造例5の抽出物に変え作成したローシ ョン。

【0037】(実施例6)実施例6は、実施例1の製造 例1の抽出物を製造例6の抽出物に変え作成したローシ ョン。

※例1の抽出物を製造例7の抽出物に変え作成したローシ

【0039】 (実施例8) 実施例8は、実施例1の製造 例1の抽出物を製造例8の抽出物に変え作成したローシ ョン、

【0040】(実施例9)実施例9は、実施例1の製造 40 例1の抽出物を製造例9の抽出物に変え作成したローシ

【0041】(実施例10)実施例10は、実施例1の 製造例1の抽出物を製造例10の抽出物に変え作成した ローション。

【0042】(実施例11)実施例11は、実施例1の 製造例1の抽出物を製造例11の抽出物に変え作成した ローション。

【0043】(実施例12)実施例12は、実施例1の 【0038】(実施例7)実施例7は、実施例1の製造※50 製造例1の抽出物を製造例12の抽出物に変え作成した

09/28/2001, EAST Version: 1.02.0008

ローション。

【0044】(実施例13)実施例13は、実施例1の 製造例1の抽出物を製造例13の抽出物に変え作成した ローション。

【0045】(実施例14)実施例14は、実施例1の 製造例1の抽出物を製造例14の抽出物に変え作成した ローション。

【0046】(5α-レダクターゼ阻害試験)

(試験方法) 製造例及び比較例の1%液を0.5ml、0.18%テストステロン、プロピレングリコール溶液 10を0.5ml、0.1%β-ニコチンアミドアデニンジ ヌクレオチドリン酸 (NADPH)、トリスーHC 1緩 衝液 (50mM、pH7.2)を5.0ml、5α-レ ダクターゼ酵素液としてオリエンタル酵母工業株式会社 製 S-9を1.0ml、これらをよく混合し、37℃で30min恒温水槽に放置する。

【0047】次にエキストレート20カラム(メルク社製)に入れ、10min放置した後、ジクロロメタン40~50mlで分取する。エバボレート後、エタノール5mlに溶解しガスクロマトグラフィー分析で分析した。

GC条件は

カ ラ ム: CBP1-W12-100 (メチルシリコーン系)

カラム温度:235℃恒温

検 出 器:水素炎検出器(FID);280℃,インジ

ェクション;280℃ その結果を表1に示す。

[0048]

【表1】

阻害率
27.1%
23.6%
35.0%
40.7%
42.1%
78.9%
44.0%
55.0%
27.6%
65.1%
53.7%
47.0%
21.3%
54.5%
3. 8%
15.3%

【0049】(使用テスト) 男性で、頭髪が薄くなりつつある人に各実施例のローションを6ケ月間毎日使用してもらった。各実施例毎に5人をパネルとして依頼し

40 た。その評価基準を有効と判定した人、やや有効と判定した人、効果なしと判定した人に分けて、その人数を表2に示す。

【0050】

【表2】

30

-

	有 効	やや有効	効果なし
実施例1	2	1	2
実施例2	2	2	1
実施例3	3	1	1
実施例 4	3	0	2
実施例5	3	1	1
実施例6	4	1	0
実施例7	3	1	1
実施例8	4	0	1
実施例 9	2	2	1
実施例10	4	1	0
実施例11	3	2	0
実施例12	3	1	1
実施例13	1	4	0
実施例14	2	3	0

[0051]

【発明の効果】本発明の植物体の溶媒抽出物は、5α-レダクターゼ阻害試験で明らかなように、5α-レダク* *ターゼの活性を顕著に抑制するので、これを配合したローションを頭皮に適用すると、優れた育毛効果が得られる。

フロントページの続き

(72)発明者 服部 征雄

富山県富山市五福末広町2556-4 2-

203

(72)発明者 下村 健次

三重県伊勢市船江3-16-32

(72)発明者 山辺 幸久

三重県伊勢市河崎1-8-21

(72)発明者 飯田 浩一

三重県伊勢市黒瀬町56-1